

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 4 月 7 日 (07.04.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/030720 A1(51) 国際特許分類⁷: C07D 211/48, 409/04, 211/70, A61K
31/4409, 31/4436, 31/4515, 31/4535, A61P 25/04, 43/00(74) 代理人: 山内秀晃, 外(YAMAUCHI, Hideaki et al.); 〒
5530002 大阪府大阪市福島区鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号
塩野義製薬株式会社 知的財産部 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/013775

(22) 国際出願日: 2004 年 9 月 22 日 (22.09.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

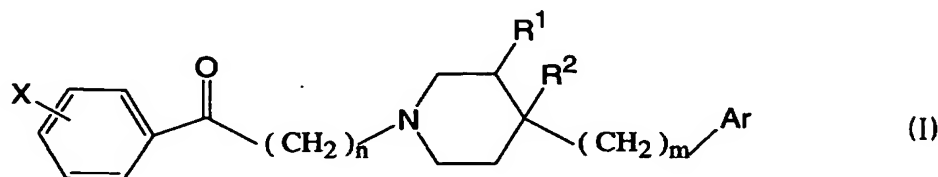
(30) 優先権データ:
特願2003-332629 2003 年 9 月 25 日 (25.09.2003) JP(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 塩野義
製薬株式会社 (SHIONOGI & CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
5410045 大阪府大阪市中央区道修町 3 丁目 1 番 8 号
Osaka (JP).(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,
TD, TG).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 矢野利定 (YANO,
Toshisada) [JP/JP]; 〒5530002 大阪府大阪市福島区
鷺洲 5 丁目 1 2 番 4 号 塩野義製薬株式会社内 Os-
aka (JP). 金政利幸 (KANEMASA, Toshiyuki) [JP/JP]; 〒
5203423 滋賀県甲賀郡甲賀町大字五反田 1 4 0 5 番
地 塩野義製薬株式会社内 Shiga (JP). 山元勝一 (YA-
MAMOTO, Shoichi) [JP/JP]; 〒5203423 滋賀県甲賀郡
甲賀町大字五反田 1 4 0 5 番地 塩野義製薬株式会
社内 Shiga (JP).添付公開書類:
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PIPERIDINE DERIVATIVE HAVING NMDA RECEPTOR ANTAGONISTIC ACTIVITY

(54) 発明の名称: NMDA 受容体拮抗作用を有するピペリジン誘導体

(57) Abstract: A piperidine derivative represented by the formula (I) was found to specifically bond to an NR1/NR2B receptor and be usable as an analgesic (therapeutic agent for pains). [Chemical formula 1] (In the formula, X is OH or lower alkylsulfonyloxy; Ar is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl; n is an integer of 1 to 4; m is an integer of 0 to 1; and R¹ is hydrogen and R² is OH or R¹ and R² in combination may form a single bond, provided that the following cases 1) and 2) are excluded: 1) n is 2, m is 0, R¹ and R² in combination form a single bond, and Ar is optionally substituted phenyl and 2) n is 3, m is 0, R¹ and R² in combination form a single bond, and Ar is phenyl.)

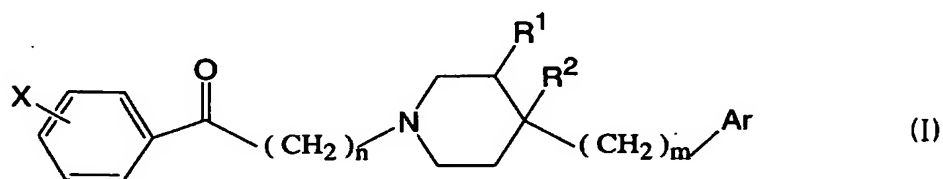
[続葉有]



(57) 要約:

式(I)で示されるピペリジン誘導体が、NR1/NR2Bの受容体に特異的に結合し、鎮痛剤(疼痛治療剤)として用いられることを見出した。

【化1】



(式中、XはOHまたは低級アルキルスルホニルオキシ; Arは置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリール; nは1〜4の整数; mは0〜1の整数; R¹は水素; R²はOH、または、R¹及びR²は一緒になって単結合を形成してもよい; 但し、1) nが2、mが0、R¹及びR²が一緒になって単結合、且つArが置換されていてもよいフェニルである場合、2) nが3、mが0、R¹及びR²が一緒になって単結合、且つArがフェニルである場合を除く)